

УД-17

РЕАКЦИИ ГЕТЕРОЦИКЛИЗАЦИИ 2-АРИЛГИДРАЗОНО-1,3-ДИКАРБОНИЛЬНЫХ СОЕДИНЕНИЙ

Н. А. Елькина, Е. В. Щегольков, Я. В. Бургарт, В. И. Салоутин

ФГБУН Институт органического синтеза им. И. Я. Постовского Уральского отделения
РАН 620990, г. Екатеринбург, ул. С. Ковалевской, 22/Академическая, 20
E-mail: natali741258@mail.ru

Нами предложены методы синтеза функционализированных азагетероциклов на основе 2-арилгидразон-1,3-дикарбонильных соединений **1**, **2**. Для получения пиразоло[1,5-а]пиримидинов использована циклизация 2-толилгидразон-1,3-дикарбонильных соединений **1**, **2** с 5-аминопиразолами **3**. При этом обнаружено, что пиразоло[1,5-а]пиримидины **6** образуются как единственные продукты в случае фенилзамещенных 2-толилгидразонилиден-1,3-дикетон-ов **2**, в то время как 2-толилгидразонилиден-3-оксоэфиры **1** помимо аналогичных пиразоло[1,5-а]пиримидинов **5** образуют 7-гидрокси-6-(2-толилгидразонилиден)-6,7-дигидропиразоло[1,5-а]пиримидин-5-оны **4** в качестве минорных продуктов (схема 1).

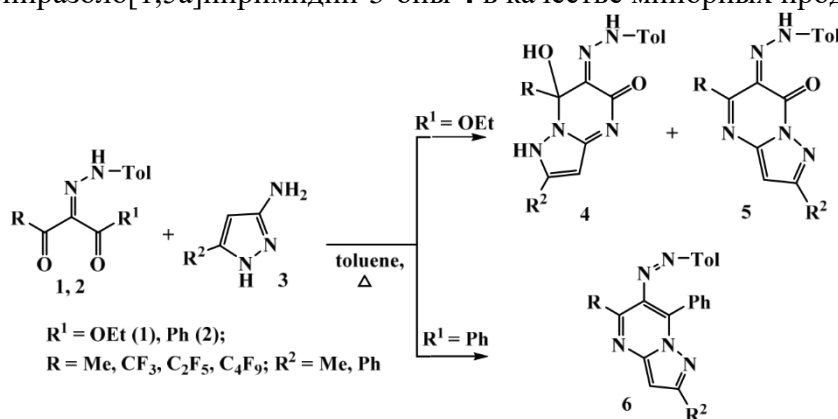


Схема 1

Однако с замещенными гидразинами **7** 2-арилгидразон-3-оксоэфиры **1** циклизуются хемоселективно в 4-арилгидразонилиденпиразолоны **8** (схема 2). Эти же гетероциклы могут быть получены путем азосочетания 3-полифторалкилпиразол-3-онов **9** с хлоридами (гет)арилдiazония **10**.

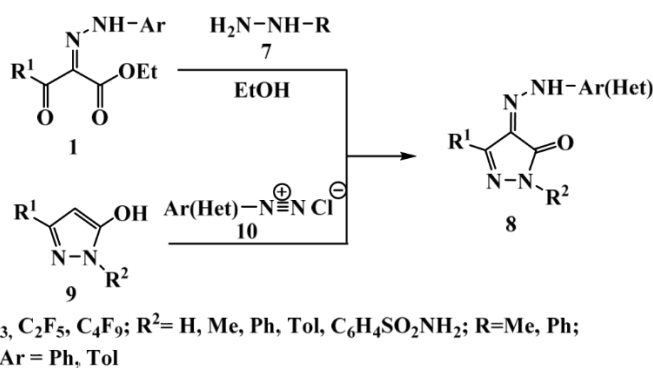


Схема 2

При изучении биологических свойств полученных гетероциклов выявлено эффективное анальгетическое действие 5-полифторалкилпиразоло[1,5-а]пиримидинов **5** и толилгидразон-замещенных пиразолонов **8** на уровне препаратов сравнения анальгин и диклофенак в тесте «горячая пластина» на крысах линии SD. Исследование острой токсичности на мышах линии CD-1 показало, что данные соединения в дозе 300 мг/кг нетоксичны.